

СИНТЕЗ α,ω -БИС-1,5,3-ДИТИАЗЕПИНАНОВ НА ОСНОВЕ АЛИФАТИЧЕСКИХ α,ω -ДИАМИНОВ С УЧАСТИЕМ $\text{SmCl}_3 \cdot 6\text{H}_2\text{O}$

Рахимова Е.Б.⁽¹⁾, Исмагилов Р.А.⁽²⁾, Валитова С.Ф.⁽¹⁾, Зайнуллин Р.А.⁽²⁾,
Ибрагимов А.Г.⁽¹⁾, Джемилев У.М.⁽¹⁾

⁽¹⁾Институт нефтехимии и катализа УНЦ РАН

450075, г. Уфа, пр. Октября, д. 141

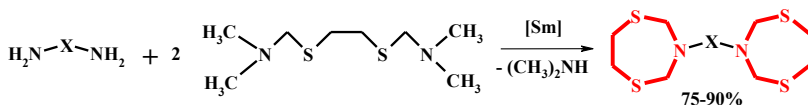
Тел/факс: (347)2842750. E-mail: ink@anrb.ru

⁽²⁾Уфимский государственный университет экономики и сервиса

450077, г. Уфа, ул. Чернышевского, д. 145

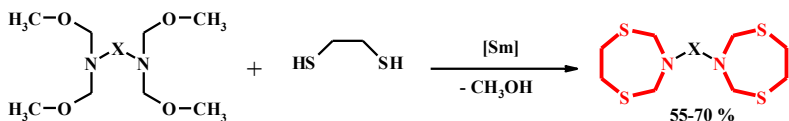
Факс: (347)2520806. E-mail: nis_utis@bashnet.ru

Гетероциклы, содержащие атомы *S* и *N*, известны как противомикробные, антигрибковые и противовоспалительные агенты. Нами разработан новый подход к синтезу практически важных *N*-замещенных насыщенных *S,N*-гетероциклов, основанный на катализируемой реакции циклотиметилирования α,ω -диаминов с помощью реагента бис-1,3-аминосульфида. Установлено, что при взаимодействии алифатических карбо- и гетероцепных α,ω -диаминов с N^l, N^l, N^o, N^o -тетраметил-2,5-дитиагексан-1,6-диамином в присутствии 5 мол % $\text{SmCl}_3 \cdot 6\text{H}_2\text{O}$ [растворитель – CHCl_3 , 20°C, 3ч] образуются α,ω -бис-1,5,3-дитиазепинаны с выходом 75-90%.



$\text{X} = (\text{CH}_2)_n$, где $n=2-10$; $(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_2\text{CH}_2$, $n=1-2$; $(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S})_2$; $(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH})_n$, $n=1-2$

В продолжение проводимых исследований в области синтеза *S,N*-содержащих гетероциклов, разработан эффективный метод получения α,ω -бис-1,5,3-дитиазепианов катализируемой межмолекулярной циклизацией α,ω -дитиолов с тетракис(метоксиметил)диаминами. Показано, что гетероциклизация 1,2-этиандитиола с помощью тетракис(метоксиметил)алкандиаминов в разработанных условиях [5 мол % $\text{SmCl}_3 \cdot 6\text{H}_2\text{O}$, $\text{MeOH}-\text{CHCl}_3$, 20 °C, 3ч] приводит к селективному образованию α,ω -бис-1,5,3-дитиазепианов с выходами 55-70%.



$\text{X} = (\text{CH}_2)_n$, где $n=2-10$; $(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_2\text{CH}_2$, $n=1-2$; $(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S})_2$; $(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH})_n$, $n=1-2$

Структура *бис*-1,5,3-дитиазепианов установлена на основании данных ЯМР с привлечением 2D методик (COSY, HSQC, HMBC, NOESY), масс-спектрометрии MALDI TOF/TOF и подтверждена методом PCA.

По результатам биологических испытаний полученных гетероциклов установлено, что *бис*-1,5,3-дитиазепианы проявляют высокий фунгицидный эффект по отношению к фитопатогенным грибам *Botrytis cinerea* и *Rhizoctonia solani*.

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского фонда фундаментальных исследований (проекты 11-03-00101-а, 11-03-97011-р_Поволжье_а).

СИНТЕЗ 2-(ФУР-2-ИЛ)- И 2-(ПИРРОЛ-2-ИЛ)МЕТИЛБЕНЗИМИДАЗОЛОВ

Редькин В.М., Коваленко Г.А., Строганова Т.А., Крапивин Г.Д.

Кубанский государственный технологический университет

350072, г. Краснодар, ул. Московская, д. 2

Производные бензимидазола многие годы представляют большой интерес для медицинской химии. Среди этих соединений выявлены вещества, обладающие различными видами биологической активности, такой как антигистаминная, антибактериальная; противовирусная, в том числе в отношении вируса иммунодефицита человека (ВИЧ), герпеса, гриппа, человеческого цитомегаловируса. Наше внимание привлекли 1,2-дизамещенные бензимидазолы, содержащие в положении 2 5-алкилфурилметильный фрагмент. Интерес к синтезу подобных структур заключается в способности диалкилфурана к рециклизации в другие гетероциклы, что позволит ввести во 2-е положение бензимидазольного кольца гетероциклические фрагменты, недоступные иными путями.

Для получения 2-фурилметилбензимидазолов на основе соответствующих *орто*-нитроанилинов нами предложена последовательность реакций, представленная на Схеме 1:

Схема 1